

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表平8-508270

(43) 公表日 平成8年(1996)9月3日

(51) Int.Cl. <sup>9</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I
C 0 7 D 207/333		9159-4C	C 0 7 D 207/333
A 6 1 K 31/34		9454-4C	A 6 1 K 31/34
31/36		9454-4C	31/36
31/40		9454-4C	31/40
31/41		9454-4C	31/41
審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 181 頁) 最終頁に続く			

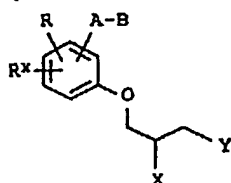
(21) 出願番号	特願平6-521616	(71) 出願人	ビーエーエスエフ アクチエンゲゼルシャ フト
(86) (22) 出願日	平成6年(1994)3月19日		ドイツ連邦共和国 D-67056 ルートヴ ィッヒスハーフェン (番地なし)
(85) 翻訳文提出日	平成7年(1995)9月29日	(72) 発明者	ヤンセン, ベルント
(86) 国際出願番号	PCT/EP94/00870		ドイツ連邦共和国 D-67063 ルートウ ィッヒスハーフェン ロイシュナーシュト ラーセ 18アー
(87) 国際公開番号	WO94/22842	(72) 発明者	クリンク, アンドレアス
(87) 国際公開日	平成6年(1994)10月13日		ドイツ連邦共和国 D-68259 マンハイ ム ハウプトシュトラーセ 1
(31) 優先権主張番号	08/038, 706	(74) 代理人	弁理士 矢野 敏雄 (外2名)
(32) 優先日	1993年3月29日		
(33) 優先権主張国	米国 (US)		
(31) 優先権主張番号	08/137, 226		
(32) 優先日	1993年10月18日		
(33) 優先権主張国	米国 (US)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 マルチ・ドラッグ耐性のモジュレーターとしての1-アミノ-3-フェノキシプロパン誘導体

(57) 【要約】

本発明は、式1:

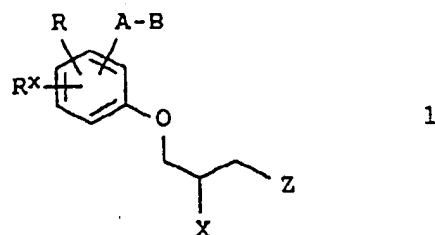


1

〔式中、A、B、R、R、XおよびZは、明細書中の記載されたように定義されている〕で示される1-アミノ-3-フェノキシプロパン誘導体および該誘導体の製造法に関する。前記化合物は、癌の化学療法の場合のマルチ・ドラッグ耐性のモジュレーターとして使用することができ、かつマラリアの処置の場合の耐性を回避するために使用することができる。

## 【特許請求の範囲】

1 式1:



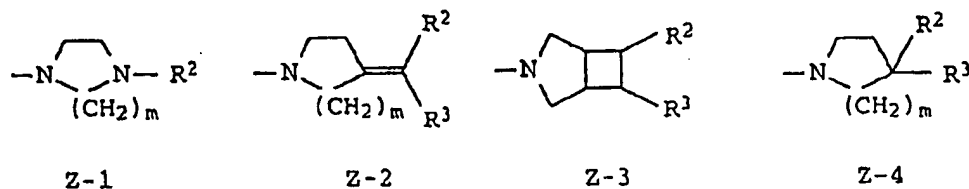
〔式中、

Xは、H、OH、OCOR'、OCOOR'、OCONHR'、OR'、OSO<sub>3</sub>-、OPO<sub>3</sub>'-（但し、R'は、線状または分枝鎖状のアルキル基；ヒドロキシアルキル基；アミノアルキル基を表わす）を表わすか；

またはフェニル基またはピリジル基（但し、これらの双方は、アルキル基、アルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、CF<sub>3</sub>、NR'R''（但し、R'およびR''は、水素原子を表わすかあるいは線状または分枝鎖状のアルキル基を表わす）からなる群から独立に選択されていてもよい3個までの置換基によって置換されていてもよい）を表わすか；またはフェニルアルキル基（但し、アルキル成分は、ヒドロキシ基またはアミノ基によって置換されていてもよく、かつフェニル基は、独立に線状または分枝鎖状アルキル、アルコキシ、ハロゲン原子、ニトロ、CF<sub>3</sub>、NR'R''（但し、R'およびR''は上記と同様に定義されている）からなる群から選択されていてもよい3個までの置換基に

よって置換されていてもよい）を表わし；

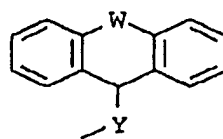
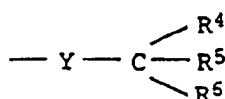
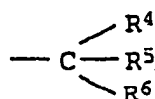
Zは、アミノヘテロ環を表わし：



〔式中、

mは、2または3であり、

R'およびR'は、互いに独立に水素原子（但し、R'およびR'は同時に水素原子ではない）、シクロアルキル基を表わすか；または環が、線状または分枝鎖状アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ、ハロゲン原子、ニトロ、CF<sub>3</sub>、NR'R''（但し、R'およびR''は上記と同様に定義されている）からなる群から選択されている3個までの置換基によって置換されていてもよいフェニル基またはフェニルアルキル基、またはピリジル基を表わし；  
 または残りは：



〔式中、

R'は、水素原子、ヒドロキシ基またはシクロアルキル基を表わし；

R'は、水素原子またはシクロアルキル基を表わし、

かつR'は、シクロアルキル基を表わすか；

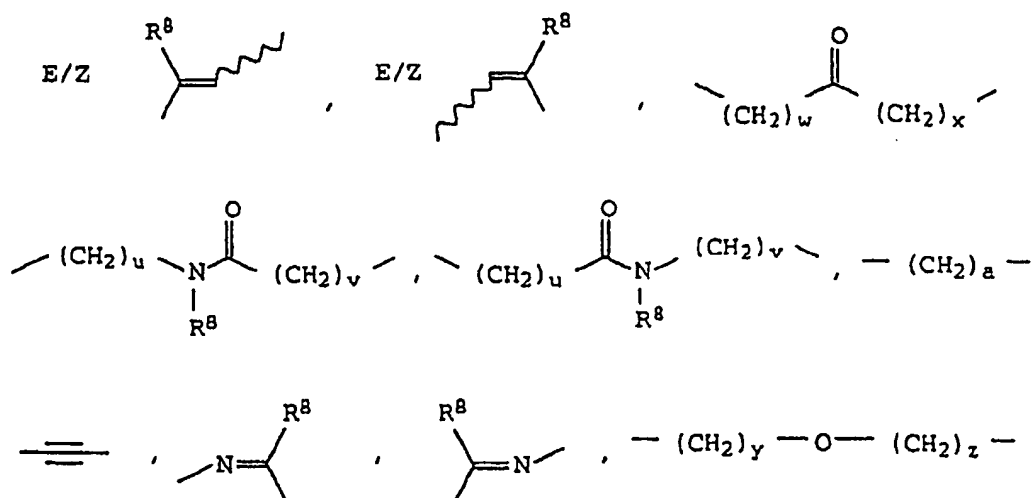
またはR'、R'およびR'は、フェニル基またはフェニルアルキル基またはピリジル基の群から独立に選択されており、この場合、これらの全ての基は、線状または分枝鎖状アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ、ハロゲン原子、ニトロ、CF<sub>3</sub>、NR'R''（但し、R'およびR''は上記と同様に定義されている）からなる群から独立に選択されていてもよい3個までの置換基によって置換されていてもよく；

Yは、カルボニル成分を表わすかまたはnが0、1、2または3である（CH<sub>2</sub>）<sub>n</sub>成分を表わし、

Wは、酸素原子、硫黄原子を表わすかまたは式：NR'<sup>1</sup>（但し、R'<sup>1</sup>は、水素原子あるいは線状または分枝鎖状のアルキル基であってもよい）で示される基、カルボニル成分または以下の成分：-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>、-、-CH=CH-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>、-、-NH-CH<sub>2</sub>-、-、-N=CH-、-(C=O)-NR'<sup>1</sup>（但し、qは、0、1または2であり、pは、0、1または2である）のいずれか1つを表

わし；

Aは、構造式：



(式中、 $R^8$ は、水素原子、線状または分枝鎖状のアルキル基、アリル基、アルコキシ基、ベンジル基または $CF_3$ を表わす)を表わし；

$a$ は、1、2、3または4であり、 $u$ および $v$ は、0、1または2であり(但し、 $u$ と $v$ との総和は、3を上廻らない)、 $w$ および $x$ は、0、1または2であり(但し、 $w$ と $x$ との総和は、3を上廻らない)、 $y$ および $z$ は、互いに独立に0、1または2であり、

Bは、以下の基：

フェニル基(但し、Aが $-O-CH_2-$ である場合には、Bは、フェニル基ではない)、ピリジル基、ピリミジル基、ピリダジニル基、ピラジニル基、ナフチル基、キノリニル基、イソキノリニル基、キノキサリニル基、キナゾリニル基、シンノリニル基、インダニル基、ベンゾフラニル基、ベンズイソチアゾリル基、ナフチリジニル基またはシクロペンタジエニル基、この場合、これら全ての基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、 $CF_3$ 、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $NR'R''$ (但し、 $R'$ および $R''$ は、上記と同様に定義さ

れている)、アルキル $-NR'R''$ (但し、 $R'$ および $R''$ は、上記と同様に定

義されている) からなる群から選択された3個までの置換基によって置換されていてもよく;

または1, 3, 5-トリアジニル基、フラニル基、チエニル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基またはイソチアゾリル基、この場合、これら全ての基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、 $\text{CF}_3$ 、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $\text{NR}'\text{R}''$  (但し、 $\text{R}'$  および  $\text{R}''$  は、上記と同様に定義されている)、アルキル- $\text{NR}'\text{R}''$  (但し、 $\text{R}'$  および  $\text{R}''$  は、上記と同様に定義されている) からなる群から選択された2個までの置換基によって置換されていてもよく;

またはインドリル基、ベンズイミダゾリル基、ピロリル基、イミダゾリル基またはピラゾリル基、この場合、これら全ての基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、 $\text{CF}_3$ 、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $\text{NR}'\text{R}''$  またはアルキル- $\text{NR}'\text{R}''$  (但し、 $\text{R}'$  および  $\text{R}''$  は、上記と同様に定義されている) からなる群から選択された3個までの置換基によって炭素が置換されていてもよく、かつ線状または分枝鎖状のアルキル基、フェ

ニルアルキル基、アシルアルキル基、フェニルアシルアルキル基またはフェニルアシル基からなる群から選択された置換基によって窒素原子が置換されていてもよく;

または1, 2, 3-トリアゾリル基または1, 2, 4-トリアゾリル基、この場合、これらの基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、 $\text{CF}_3$ 、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $\text{NR}'\text{R}''$  またはアルキル- $\text{NR}'\text{R}''$  (但し、 $\text{R}'$  および  $\text{R}''$  は、上記と同様に定義されている)、フェニル基、ベンジル基 (但し、この2個の残基は、ハロゲン原子、アルキル、アルコキシ、 $\text{CF}_3$  から選択された2個までの置換基によって独立に置換されていてもよい) からなる群から選択された置換基によって炭素原子が置換されていてもよく、かつ

線状または分枝鎖状のアルキル基、フェニルアルキル基、アシルアルキル基、フェニルアシルアルキル基またはフェニルアシル基からなる群から選択された置換基によって窒素原子が置換されていてもよく；

または1, 2, 3-オキサジアゾリル基、1, 2, 4-オキサジアゾリル基、1, 3, 5-オキサジアゾリル基、1, 2, 5-オキサジアゾリル基、1, 2, 3-チアジアゾリル基、1, 2, 4-チアジアゾリル基、1, 2, 5-チアジアゾリル基または1, 3, 5-チ

アジアゾリル基、この場合、これらの基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、 $\text{CF}_3$ 、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $\text{NR}'\text{R}''$ またはアルキル- $\text{NR}'\text{R}''$ （但し、 $\text{R}'$ および $\text{R}''$ は、上記と同様に定義されている）、フェニル基、ベンジル基（但し、この2個の残基は、ハロゲン原子、アルキル、アルコキシ、 $\text{CF}_3$ から選択された2個までの置換基によって独立に置換されていてもよい）からなる群から選択された置換基によって置換されていてもよく；

または1, 2, 3, 4-オキサトリアゾリル基または1, 2, 3, 5-オキサトリアゾリルから選択された環系を表わし；

$\text{R}$ および $\text{R}'$ は、それぞれ、水素原子、ヒドロキシ基、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{NR}'\text{R}''$ （但し、 $\text{R}'$ および $\text{R}''$ は、上記と同様に定義されている）から独立に選択された置換基を表わすかあるいは式1のフェニル成分に環付加され、従って、ナフタレン、テトラヒドロナフタレン、テトラメチルテトラヒドロナフタレン、インデン、インドール、ベンゾフラン、ベンゾチオフェン、ベンズイミダゾールからなる群から選択された二環式環を形成し、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、ニトロ基、 $\text{CF}_3$ 、ハロ

ゲン原子、ニトロ基、 $\text{NR}'\text{R}''$ （但し、 $\text{R}'$ および $\text{R}''$ は、上記と同様に定義されている）からなる群から独立に選択された3個までの置換基によって炭素原

子が場合によっては置換されている炭素環またはヘテロ環を表わす〕で示される新規の1-アミノ-3-フェノキシプロパン誘導体。

2 抗癌剤の薬効増強のための医薬調剤において、該医薬調剤が、請求項1に記載の式1の化合物または該化合物の製薬学的に認容性の塩と製薬学的に認容性の担持剤または希釈剤からなることを特徴とする、抗癌剤の薬効増強のための医薬調剤。

3 化学療法剤の作用量および化学療法剤の抗腫瘍作用を増強する化合物の作用量からなる抗腫瘍用組成物において、増強剤が請求項1の化合物から選択されていることを特徴とする、抗腫瘍用組成物。

4) 癌によって苦しむ患者の癌を治療するための方法において、前記の患者に抗癌剤および式1の化合物を投与することを特徴とする癌の治療法。

## 【発明の詳細な説明】

マルチ・ドラッグ耐性のモジュレーターとしての1-アミノ-3-フェノキシ-  
プロパン誘導体

化学療法剤に抗する耐性の発生は、臨床的な癌治療の場合の度重なる過ちに主たる原因がある。癌細胞の型に応じて、種々の分子メカニズムは、化学療法剤を無力にしてしまう。

マルチ・ドラッグ耐性 (Multi-Drug-Resistant) (以下、MDRと省略される) 表現型 (S. Kuzmich他、Med. Res. Rev. 1991年、第11巻、第185頁) という語は、単独の細胞毒性剤に対する耐性のために使用されてはいるが、しかし、構造的にも機能的にも関係のない種々の化合物が相互耐性を示すことが見出されているような表現型のために作り出されたものである。このMDR表現型は、ビニカ・アルカロイド、アントラシクリンおよびエピボドフィロトキシンを用いる処理について観察される。プラスの相互関係は、170 Kダルトンの分子量のMDR1-遺伝子生成物p-糖蛋白質 (以下、P170と省略される) と、MDRの出現との間に存在する (J. Bell他、Cancer Invest. 1991年、第9巻、第563頁)。p170は、ATPによりエネルギー供給された流出ポン

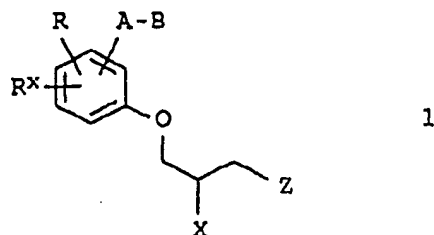
プとして作用し、このポンプは、細胞毒性化合物を内部細胞質からむしろ非特異的方法で排出する。この数年、異なる種類の化合物が、MDRを変化させることが見出された。この種の化合物は：ベラパミル (verapamil) (E. Pommerenke他、Arzneim.-Forsch. 1991年、第41巻 (II)、第855頁)、ニグルジピン (niguldipine) (A. Reymann他、Arch. Pharmacol. 1991年、343、Suppl. R50)、シクロスポリン (cyclosporine) Aおよびキニーネ (quinine) (E. Solary他、Cancer 1991年、第68巻、第1714頁) である。前記化合物の全ては、MDR変性以外の臨床的な使用のために開発されたので、深刻な副作用を有している (例えば、血圧降下または免疫系の抑制)。このことは、慣用の癌治療の場合に、MDRモジュレーターとしての化合物を使用することを困難なものにしてしまう。従って、副作用または毒性を低減した新規のモジュレーターが必要とされる。

本発明は、ピンクリスチン、ピンブラスチン、アドリアマイシンおよびエトボ



サイドのような化学療法剤に抗する腫瘍細胞の耐性を変性するのに効力がある 1-アミノ-3-フェノキシ-プロパン-誘導体の調製および使用を記載するものである。

本発明は、式 1 :

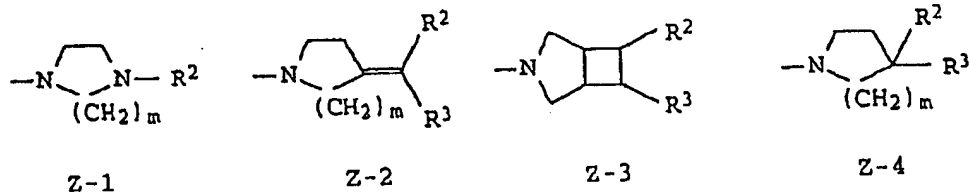


〔式中、

Xは、H、OH、OCOR'、OCOOR'、OCONHR'、OR'、OSO<sub>2</sub>-、OPO<sub>3</sub>'-（但し、R'は、線状または分枝鎖状のアルキル基；ヒドロキシアルキル基；アミノアルキル基を表わす）を表わすか；

またはフェニル基またはピリジル基（但し、これらの双方は、アルキル基、アルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、CF<sub>3</sub>、NR'R''（但し、R'およびR''は、水素原子を表わすかあるいは線状または分枝鎖状のアルキル基を表わす）からなる群から独立に選択されていてもよい3個までの置換基によって置換されていてもよい）を表わすか；またはフェニルアルキル基（但し、アルキル成分は、ヒドロキシ基またはアミノ基によって置換されていてもよく、かつフェニル基は、独立に線状または分枝鎖状アルキル、アルコキシ、ハロゲン原子、ニトロ、CF<sub>3</sub>、NR'R''（但し、R'およびR''は上記と同様に定義されている）からなる群から選択されていてもよい3個までの置換基によって置換されていてもよい）を表わし；

Zは、アミノヘテロ環を表わし：

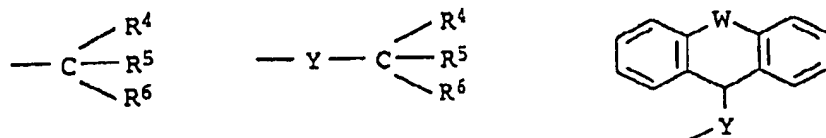


〔式中、

mは、2または3であり、

R'およびR''は、互いに独立に水素原子（但し、R'およびR''は同時に水素原子ではない）、シクロアルキル基を表わすか；または環が、線状または分枝鎖状アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ、ハロゲン原子、ニトロ、CF<sub>3</sub>、NR'R''（但し、R'およびR''は上記と同様に定義されている）からなる群から選択されている3個までの置換基によって置換されていてもよいフェニル基またはフェニルアルキル基、またはピリジル基を表わし；

または残りは：



〔式中、

R'は、水素原子、ヒドロキシ基またはシクロアルキル基を表わし；

R'は、水素原子またはシクロアルキル基を表わし、かつR'は、シクロアルキル基を表わすか；

またはR'、R'およびR''は、フェニル基またはフェニルアルキル基またはピリジル基の群から独立に選択されており、この場合、これらの全ての基は、線状または分枝鎖状アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ、ハロゲン原子、ニトロ、CF<sub>3</sub>、NR'R''（

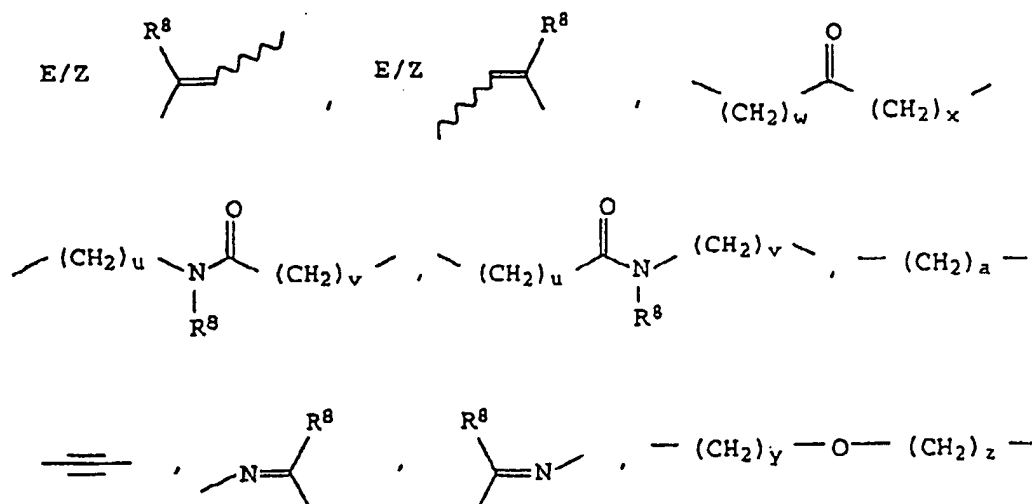
但し、R'およびR''は上記と同様に定義されている）からなる群から独立に選択されていてもよい3個までの置換基によって置換されていてもよく；

Yは、カルボニル成分を表わすかまたはnが0、1、2または3である（CH<sub>2</sub>）<sub>n</sub>成分を表わし、

Wは、酸素原子、硫黄原子を表わすかまたは式：NR'''（但し、R'''は、水素原子あるいは線状または分枝鎖状のアルキル基であってもよい）で示される基、カルボニル成分または以下の成分：-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-, -CH=CH-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-, -NH-CH<sub>2</sub>-, -N=CH-, -(C=O)-NR'''（但し、qは、0、1または2であり、pは、0、1または2である）のいずれか1つを表

わし；

A は、構造式：



(式中、 $R^8$ は、水素原子、線状または分枝鎖状のアルキル基、アリル基、アルコキシ基、ベンジル基また

は $CF_3$ を表わす)を表わし；

$a$ は、1、2、3または4であり、 $u$ および $v$ は、0、1または2であり(但し、 $u$ と $v$ との総和は、3を上廻らない)、 $w$ および $x$ は、0、1または2であり(但し、 $w$ と $x$ との総和は、3を上廻らない)、 $y$ および $z$ は、互いに独立に0、1または2であり、

Bは、以下の基：

フェニル基(但し、Aが $-O-CH_2-$ である場合には、Bは、フェニル基ではない)、ピリジル基、ピリミジル基、ピリダジニル基、ピラジニル基、ナフチル基、キノリニル基、イソキノリニル基、キノキサリニル基、キナゾリニル基、シンノリニル基、インダニル基、ベンゾフラニル基、ベンズイソチアゾリル基、ナフチリジニル基またはシクロペンタジエニル基、この場合、これら全ての基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、 $CF_3$ 、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $NR'R''$ (但し、 $R'$ および $R''$ は、上記と同様に定義されている)、アルキル $-NR'R''$ (但し、 $R'$ および $R''$ は、上記と同様に

定義されている) からなる群から選択された3個までの置換基によって置換されていてもよく;

または1, 3, 5-トリアジニル基、フラニル基、チエニル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チア

ゾリル基またはイソチアゾリル基、この場合、これら全ての基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、 $CF_3$ 、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $NR'R''$  (但し、 $R'$  および  $R''$  は、上記と同様に定義されている)、アルキル- $NR'R''$  (但し、 $R'$  および  $R''$  は、上記と同様に定義されている) からなる群から選択された2個までの置換基によって置換されていてもよく;

またはインドリル基、ベンズイミダゾリル基、ピロリル基、イミダゾリル基またはピラゾリル基、この場合、これら全ての基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、 $CF_3$ 、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $NR'R''$  またはアルキル- $NR'R''$  (但し、 $R'$  および  $R''$  は、上記と同様に定義されている) からなる群から選択された3個までの置換基によって炭素が置換されていてもよく、かつ線状または分枝鎖状のアルキル基、フェニルアルキル基、アシルアルキル基、フェニルアシルアルキル基またはフェニルアシル基からなる群から選択された置換基によって窒素原子が置換されていてもよく;

または1, 2, 3-トリアゾリル基または1, 2, 4-トリアゾリル基、この場合、これらの基は、線状ま

たは分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、 $CF_3$ 、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $NR'R''$  またはアルキル- $NR'R''$  (但し、 $R'$  および  $R''$  は、上記と同様に定義されている)、フェニル基、ベンジル基 (但し、この2個の残基は、ハロゲン原子、アルキル、アルコキシ、 $CF_3$  から選択された2個ま

での置換基によって独立に置換されていてもよい) からなる群から選択された置換基によって炭素原子が置換されていてもよく、かつ線状または分枝鎖状のアルキル基、フェニルアルキル基、アシルアルキル基、フェニルアシルアルキル基またはフェニルアシル基からなる群から選択された置換基によって窒素原子が置換されていてもよく;

または1, 2, 3-オキサジアゾリル基、1, 2, 4-オキサジアゾリル基、1, 3, 5-オキサジアゾリル基、1, 2, 5-オキサジアゾリル基、1, 2, 3-チアジアゾリル基、1, 2, 4-チアジアゾリル基、1, 2, 5-チアジアゾリル基または1, 3, 5-チアジアゾリル基、この場合、これらの基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、 $\text{CF}_3$ 、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $\text{NR}'\text{R}''$  またはアルキル- $\text{NR}'\text{R}''$  (但し、 $\text{R}'$  および  $\text{R}''$  は、上記と同様に定義され

ている)、フェニル基、ベンジル基 (但し、この2個の残基は、ハロゲン原子、アルキル、アルコキシ、 $\text{CF}_3$  から選択された2個までの置換基によって独立に置換されていてもよい) からなる群から選択された置換基によって置換されていてもよく;

または1, 2, 3, 4-オキサトリアゾリル基または1, 2, 3, 5-オキサトリアゾリルから選択された環系を表わし;

$\text{R}$  および  $\text{R}'$  は、それぞれ、水素原子、ヒドロキシ基、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{NR}'\text{R}''$  (但し、 $\text{R}'$  および  $\text{R}''$  は、上記と同様に定義されている) から独立に選択された置換基を表わすかあるいは式1のフェニル成分に環付加され、従って、ナフタレン、テトラヒドロナフタレン、テトラメチルテトラヒドロナフタレン、インデン、インドール、ベンゾフラン、ベンゾチオフェン、ベンズイミダゾールからなる群から選択された二環式環を形成し、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、ニトロ基、 $\text{CF}_3$ 、ハロゲン原子、ニトロ基、 $\text{NR}'\text{R}''$  (但し、 $\text{R}'$  および  $\text{R}''$  は、上記と同様に定義されている) からなる群から独立に選択された3個

までの置換基によって炭素原子が場合によっては置換されている炭素環またはヘテロ環を表わす)で示される新規の1-アミノ-3-フェノキシ-プロパン誘導体を提供する。

式1の化合物は、種々の立体中心を有していてもよく、全ての可能な異性体の混合物を含める前記化合物の全ての可能な立体異性体および位置異性体は、請求項1により包含されていることが理解される。1個またはそれ以上の立体中心を有する式1の化合物のエナンチオマー的に純粋な物質は、以下の方法：エナンチオマー的に純粋な出発物質の使用、光学活性の酸を用いて形成されたジアステレオ異性体の塩の分別結晶化、キラル固定相を用いるクロマトグラフィーによる分離によって得ることができる。

式1の1-アミノ-3-フェノキシ-プロパン誘導体は、遊離塩基または該遊離塩基の製薬学的に適当な塩として使用することができる。塩の形成のための有利な酸は、塩酸、臭化水素酸、硫酸、燐酸、メタンスルホン酸、4-トルエンスルホン酸、フマル酸、リンゴ酸、蔞酸、マロン酸、クエン酸、酒石酸、プロピオン酸、酢酸、蟻酸、安息香酸または(例えば、J. Pharm. Sci., 第66巻、第1号、第1~17頁(1977年)に記載されているような)他の生理学的に認容性の酸である。

本願明細書で使用されているものとしては、上記の用語は、以下の有利な意味を有する：

ハロゲン原子は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子またはヨウ素原子を表わし；  
アルキル基は、メチル基、エチル基、プロピル基またはブチル基もしくは前記の基の位置的異性体を表わし；

$\text{NR}'\text{R}''$  は、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、第三ブチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルエチルアミノ基、ジプロピルアミノ基、ジイソプロピルアミノ基を表わし；

アルコキシ基は、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、ブトキシ基または前

記の基の位置的異性体を表わし；

ヒドロキシアルキル基は、2-ヒドロキシエチル基、2-ヒドロキシプロピル基、2-ヒドロキシブチル基を表わし；

アミノアルキル基は、1-アミノメチル基、1-アミノエチル基、1-アミノメチルプロピル基を表わし；

フェニルアルキル基は、フェニルメチル基、2-(フェニル)-エチル基、3-(フェニル)-プロピル基または前記の基の位置的異性体を表わし、この場合、付加的に、線状または分枝鎖状のアルキル基（有利に $C_1 \sim C_4$ ）、ヒドロキシ基、アルコキシ基（有利に $C_1 \sim C_4$ ）、ハロゲン原子、ニトロ基、 $CF_3$ 、 $NR'$ 、 $R''$ （但し、 $R'$ および $R''$ は、上記と同様に定義されている）からなる群から独立に選択されていてもよい3個までの置換基によって置換されていてもよく；アルキレンジオキシ基は、メチレンジオキシ基、エチレンジオキシ基を表わし；Zは、ピペラジン、ホモピペラジン、ピペリジン、ホ

モピペリジンのような置換アミノヘテロ環を表わすかまたは6位および／または7位で置換されたエキソ-3-アザビシクロ-[3.2.0]-ヘプタンのような環付加された二環式基を表わす。

Zの成分である $R'$ および $R''$ の例は、以下の基：

水素原子（但し、 $R'$ および $R''$ は、同時には水素原子ではない）；

フェニル基、4-フルオロフェニル基、4-クロロフェニル基、4-第三ブチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、3-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、3-第三ブチルフェニル基、3-メトキシフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、2-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、2-第三ブチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、2-ジメチルアミノフェニル基、3,4-ジメトキシフェニル基、2,3,4-トリメトキシフェニル基、3,4,5-トリメトキシフェニル基、3,4-メチレンジオキシフェニルフェニルメチル基、（4-フルオロフェニル）-メチル基、（4-クロロフェニル）-メチル基、（4-

第三ブチルフェニル) -メチル基、(4-メトキシフェニル) -メチル基、(4-トリフルオロメチルフェニル) -メチル基、(4-ジメチルアミノフェニル) -

メチル基、(3-フルオロフェニル) -メチル基、(3-クロロフェニル) -メチル基、(3-第三ブチルフェニル) -メチル基、(3-メトキシフェニル) -メチル基、(3-トリフルオロメチルフェニル) -メチル基、(3-ジメチルアミノフェニル) -メチル基、(2-フルオロフェニル) -メチル基、(2-クロロフェニル) -メチル基、(2-第三ブチルフェニル) -メチル基、(2-メトキシフェニル) -メチル基、(2-トリフルオロメチルフェニル) -メチル基、(2-ジメチルアミノフェニル) -メチル基、(3, 4-ジメトキシフェニル) -メチル基、(2, 3, 4-トリメトキシフェニル) -メチル基、(3, 4, 5-トリメトキシフェニル) -メチル基、(3, 4-メチレンジオキシフェニル) -メチルフェニルエチル基、(4-フルオロフェニル) -エチル基、(4-クロロフェニル) -エチル基、(4-第三ブチルフェニル) -エチル基、(4-メトキシフェニル) -エチル基、(4-トリフルオロエチルフェニル) -エチル基、(4-ジメチルアミノフェニル) -エチル基、(3-フルオロフェニル) -エチル基、(3-クロロフェニル) -エチル基、(3-第三ブチルフェニル) -エチル基、(3-メトキシフェニル) -エチル基、(3-トリフルオロメチルフェニル) -エチル基、(3-ジメチルアミノフェニル) -エチル基、(2-フルオロフェニル) -エチル基、(2-クロロフェニル) -

エチル基、(2-第三ブチルフェニル) -エチル基、(2-メトキシフェニル) -エチル基、(2-トリフルオロメチルフェニル) -エチル基、(2-ジメチルアミノフェニル) -エチル基、(3, 4-ジメトキシフェニル) -エチル基、(2, 3, 4-トリメトキシフェニル) -エチル基、(3, 4, 5-トリメトキシフェニル) -エチル基、(3, 4-メチレンジオキシフェニル) -エチル基、(3, 4-ジメトキシフェニル) -エチル基、(2, 3, 4-トリメトキシフェニル) -エチル基、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、(2-ピ



リジル) - メチル基、(3-ピリジル) - メチル基、(4-ピリジル) - メチル基、(2-ピリジル) - エチル基、(3-ピリジル) - エチル基、(4-ピリジル) - エチル基、ジフェニルメチル基、ビス(4-フルオロフェニル) - メチル基、ビス(4-クロロフェニル) - メチル基、ビス(4-第三ブチルフェニル) - メチル基、ビス(4-メトキシフェニル) - メチル基、ビス(4-トリフルオロメチルフェニル) - メチル基、ビス(4-ジメチルアミノフェニル) - メチル基、ビス(3, 4-ジメトキシフェニル) - メチル基、ビス(2, 3, 4-トリメトキシフェニル) - メチル基、ビス(3, 4, 5-トリメトキシフェニル) - メチル基、ビス(2-ピリジル) - メチル基、ビス(3-ピリジル) - メチル基、ビス(4-ピリジル) - メチル基、2, 2-ジフ

ェニルエチル基、2, 2-ビス(4-フルオロフェニル) - エチル基、2, 2-ビス(4-クロロフェニル) - エチル基、2, 2-ビス(4-第三ブチルフェニル) - エチル基、2, 2-ビス(4-メトキシフェニル) - エチル基、2, 2-ビス(4-トリフルオロメチルフェニル) - エチル基、2, 2-ビス(4-ジメチルアミノフェニル) - エチル基、2, 2-ビス(3, 4-ジメトキシフェニル) - エチル基、2, 2-ビス(2, 3, 4-トリメトキシフェニル) - エチル基、2, 2-ビス(3, 4, 5-トリメトキシフェニル) - エチル基、2, 2-ビス(2-ピリジル) - エチル基、2, 2-ビス(3-ピリジル) - エチル基、2, 2-ビス(4-ピリジル) - エチル基、トリフェニルメチル基、フェニル - (2-ピリジル) - メチル基、フェニル - (3-ピリジル) - メチル基、フェニル - (4-ピリジル) - メチル基、2-フェニル - 2 - (2-ピリジル) - エチル基、2-フェニル - 2 - (3-ピリジル) - エチル基、2-フェニル - 2 - (4-ピリジル) - エチル基、シクロヘキシル - フェニル - メチル基、2-シクロヘキシル - 2-フェニル - エチル基、シクロヘキシル - (2-ピリジル) - メチル基、シクロヘキシル - (3-ピリジル) - メチル基、シクロヘキシル - (4-ピリジル) - メチル基、2 - (シクロヘキシル) - 2 - (2-ピリジル) - エチル基、2-シクロヘキシル - 2 - (3-ピリジル)

-エチル基、2-シクロヘキシル-2-(4-ピリジル)-エチル基、3,3-ジフェニルプロピル、3,3,3-トリフェニルプロピル基、フェニルアセチル基、2-(4-フルオロフェニル)-アセチル基、2-(4-クロロフェニル)-アセチル基、2-(4-第三ブチルフェニル)-アセチル基、2-(4-メトキシフェニル)-アセチル基、2-(4-トリフルオロアセチルフェニル)-アセチル基、2-(4-ジメチルアミノ-フェニル)-アセチル基、2-(3,4-ジメトキシフェニル)-アセチル基、2-(2,3,4-トリメトキシフェニル)-アセチル基、2-(2-ピリジル)-アセチル基、2-(3-ピリジル)-アセチル基、2-(4-ピリジル)-アセチル基、2,2-ジフェニルアセチル基、2,2-トリフェニルアセチル基、2,2-ビス(4-フルオロフェニル)-アセチル基、2,2-ビス(4-クロロフェニル)-アセチル基、2,2-ビス(4-第三ブチルフェニル)-アセチル基、2,2-ビス(4-メトキシフェニル)-アセチル基、2,2-ビス(4-トリフルオロエチルフェニル)-アセチル基、2,2-ビス(4-ジメチルアミノ-フェニル)-アセチル基、2,2-ビス(3,4-ジメトキシフェニル)-アセチル基、2,2-ビス(2,3,4-トリメトキシフェニル)-アセチル基、2,2-ビス(2-ピリジル)-アセチル基、2,2-ビス(3-ピリジル)-アセチル基、2,

2-ビス(4-ピリジル)-アセチル基、2-フェニル-2-(2-ピリジル)-アセチル基、2-フェニル-2-(3-ピリジル)-アセチル基、2-フェニル-2-(4-ピリジル)-アセチル基、2-シクロヘキシル-2-フェニル-アセチル基、2-シクロヘキシル-2-(2-ピリジル)-アセチル基、2-シクロヘキシル-2-(3-ピリジル)-アセチル基、2-シクロヘキシル-2-(4-ピリジル)-アセチル基、5-フルオレニル基、5-ジベンゾスベラニル基、5-ジベンゾスベレニル基、5-ジベンゾスベラニリデン基、5-ジベンゾスベレニリデン基、9,10-ジヒドロアントラセニル基、9-キサンテニル基、9-チオキサンテニル基、6,11-ジヒドロベンズ[b,e]オキセピニー11-イル基、ジベンゾ-[b,f]アゼピニー5-イル基、10,11-ジヒドロジベンゾ[b,f]アゼピニー5-イル基、フルオレン-5-カルボニル基

、ジベンゾスベロン-5-カルボニル基、ジベンゾスベレン-5-カルボニル基、9, 10-ジヒドロアントラセン-カルボニル基、キサンテン-9-カルボニル基、9-チオキサンテンカルボニル基、6, 11-ジヒドロベンズ [ b, e ] オキセピン-11-カルボニル基、ジベンゾ [ b, f ] アゼピン-5-カルボニル基、10, 11-ジヒドロベンゾ [ b, f ] アゼピン-5-カルボニル基を含む。

A は、以下の基の1つを表す：

(E)-ビニレン、(Z)-ビニレン、(E)-1-メチル-ビニレン、(E)-1-エチル-ビニレン、(E)-1-プロピル-ビニレン、(E)-1-ブチル-ビニレン、(E)-1-イソ-プロピル-ビニレン、(E)-1-第三ブチル-ビニレン、(Z)-1-メチル-ビニレン、(Z)-1-エチル-ビニレン、(Z)-1-プロピル-ビニレン、(Z)-1-ブチル-ビニレン、(Z)-1-イソプロピル-ビニレン、(Z)-第三ブチル-ビニレン、(E)-2-メチル-ビニレン、(E)-2-エチル-ビニレン、(E)-2-プロピル-ビニレン、(E)-2-ブチル-エチニル、(E)-2-イソプロピル-ビニレン、(E)-2-第三ブチル-ビニレン、(Z)-2-メチル-ビニレン、(Z)-2-エチル-ビニレン、(Z)-2-プロピル-ビニレン、(Z)-2-ブチル-ビニレン、(Z)-2-イソプロピル-ビニレン、(Z)-2-第三ブチル-ビニレン、(E)-1-トリフルオロメチル-ビニレン、(Z)-1-トリフルオロメチル-ビニレン；

(E)-1-メトキシ-ビニレン、(E)-1-エトキシ-ビニレン、(E)-1-プロポキシ-ビニレン、(E)-1-ブトキシ-ビニレン、(E)-1-イソプロポキシ-ビニレン、(E)-1-第三ブトキシ-ビニレン、(E)-2-メトキシ-ビニレン、(E)

-2-エトキシ-ビニレン、(E)-2-プロポキシ-ビニレン、(E)-2-ブトキシ-ビニレン、(E)-2-イソプロポキシ-ビニレン、(E)-2-第三ブトキシ-ビニレン、(Z)-1-メトキシ-ビニレン、(Z)-1-エトキ

シービニレン、(Z)-1-プロポキシビニレン、(Z)-1-ブトキシビニレン、(Z)-1-イソプロポキシビニレン、(Z)-1-第三ブトキシビニレン、(Z)-2-メトキシビニレン、(Z)-2-エトキシビニレン、(Z)-2-プロポキシビニレン、(Z)-2-ブトキシビニレン、(Z)-2-イソプロポキシビニレン、(Z)-2-第三ブトキシビニレン；  
エチニレン；

メチレン、ジメチレン、トリメチレン、テトラメチレン；

カルボニル、カルボニルメチレン、メチレンカルボニル、カルボニルジメチレン、メチレンカルボニルメチレン、ジメチレンカルボニル、カルボニルトリメチレン、トリメチレンカルボニル、メチレンカルボニルジメチル、ジメチレンカルボニルメチレン；

オキシ、オキシメチレン、オキシジメチレン、メチレンオキシ、ジメチレンオキシ、メチレンオキシメチレン、メチレンオキシジメチレン、ジメチレンオキシメチレン、ジメチレンオキシジメチレン；

カルボニルイミノ、メチレンカルボニルイミノ、N-

メチル-カルボニルイミノ、N-メチル-メチレンカルボニルイミノ、イミノカルボニル、イミノカルボニルメチレン、N-メチル-イミノカルボニル、N-メチル-イミノメチレンカルボニル、N-ジメチレンカルボニルイミノ、N-エチル-ジメチレンカルボニルイミノ、N-エチル-イミノカルボニル、N-エチル-イミノジメチレン、N-プロピル-カルボニルイミノ、N-プロピル-ジメチレンカルボニル、N-プロピル-イミノカルボニル、N-プロピル-イミノメチレンカルボニル、N-イソプロピル-カルボニルイミノ、N-イソプロピル-メチレンカルボニルイミノ、N-イソプロピル-イミノカルボニル、N-イソプロピル-イミノメチレンカルボニル、カルボニルイミノメチレン、ジメチレンカルボニルイミノメチレン、カルボニル-N-メチル-イミノメチレン、カルボニル-N-エチル-イミノメチレン、カルボニル-N-プロピル-イミノメチレン、カルボニル-N-イソプロピル-イミノメチレン、ジメチレンカルボニル-N-メチル-イミノメチレン、ジメチレンカルボニル-N-エチル-イミノメチレン

、ジメチレンカルボニル-N-プロピル-イミノメチレン、ジメチレンカルボニル-N-イソプロピル-イミノメチル；

メチリデンアザ、アザメチリデン、メチレンメチリデンアザ、ジメチレンメチリデンアザ、トリメチレンメチリデンアザ、(メチル)-メチリデンアザ、(イソ

プロピル)-メチリデンアザ、(第三ブチル)-メチリデンアザ、(トリフルオロメチル)-メチリデンアザ、アザメチリデンメチレン、アザメチリデンジメチレン、アザメチリデントリメチレン、アザ-(メチル)-メチリデン、アザ-(第三ブチル)-メチリデン、アザ-(トリフルオロメチル)-メチリデン、(メトキシ)-メチリデンアザ、(エトキシ)-メチリデンアザ、(プロポキシ)-メチリデンアザ、(ブトキシ)-メチリデンアザ、(イソプロポキシ)-メチリデンアザ、(第三ブトキシ)-メチリデンアザ、アザ-(メトキシ)-メチリデン、アザ-(エトキシ)-メチリデン、アザ-(プロポキシ)-メチリデン、アザ-(ブトキシ)-メチリデン、アザ-(イソプロポキシ)-メチリデン、アザ-(第三ブトキシ)-メチリデン；

シクロプロピレン、3-メチル-シクロプロピレン、3,3-ジメチル-シクロプロピレン、3-エチル-シクロプロピレン、3-プロピル-シクロプロピレン、3-ブチルシクロプロピレン、3-イソプロピル-シクロプロピレン、3-第三ブチル-シクロプロピレン、3-フルオロ-シクロプロピレン、3-クロロ-シクロプロピレン、オキシラニレン。

Xは、以下の基の1つを表す：

水素原子、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、イソプロポキシ、第三ブトキシ、フ

ェノキシ、ベンジルオキシ、フェネトキシ、ホルミルオキシ、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、2-ヒドロキシ-プロピオニルオキシ、2-アミノ-アセチルオキシ、2-アミノ-プロピオニルオキシ、2-アミノ-3-メチル-プロピオニルオキシ、ベンゾイルオキシ、2-ピリドイル、3-ピリドイル、4-ピリドイル、2-フェニル-アセチルオキシ、2-フェニル-アセチルオキシ、2

ーヒドロキシ-2-フェニルアセチルオキシ；

メチルアミノカルボニルオキシ、フェニルアミノカルボニルオキシ。

R および R' は、それぞれ、以下の基から独立に選択することができる2個までの基を表す：

メチル、エチル、n-プロピル、ブチル、イソプロピル、第三ブチル、トリフルオロメチルメトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、イソプロポキシ、第三ブトキシ、フルオロ、クロロ、ブロモ、ニトロ、アミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、第三ブチルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、メチルエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ；

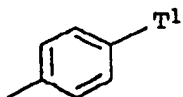
または R および R' は、この R および R' を結合しているフェニル基と一緒になつて、以下の群：

ナフタレン、テトラヒドロナフタレン、テトラメチルテトラヒドロナフタレン、インデン、インドール、ベ

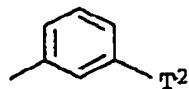
ンゾフラン、ベンゾチオフェン、ベンズイミダゾールから選択された二環式環系を形成する。

B の例は、以下のような構造を包含する：

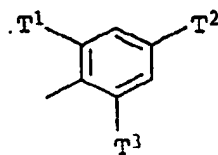
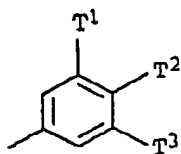
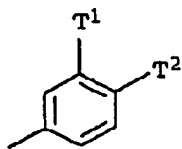
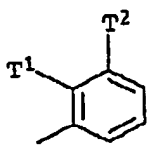
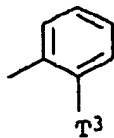
$T^1 =$  H, F, Cl, Br, I,  $CH_3$ ,  $CH_2CH_3$ , OH,  $OCH_3$ ,  $CF_3$ ,  $OCH_2CH_3$ ,  
 CN,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $N(CH_3)_2$ ,  $COOCH_3$ ,  $COOCH_2CH_3$



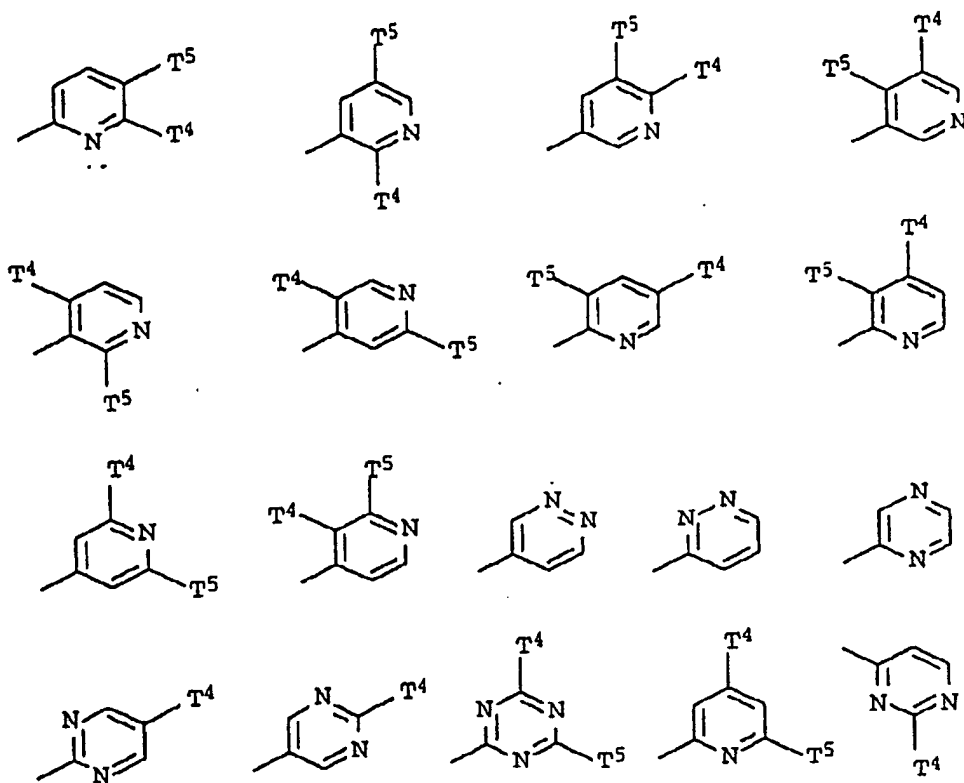
$T^2 =$  H, F, Cl, Br, I,  $CH_3$ ,  $CH_2CH_3$ , OH,  $OCH_3$ ,  $CF_3$ ,  $OCH_2CH_3$ ,  
 CN,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $N(CH_3)_2$ ,  $COOCH_3$ ,  $COOCH_2CH_3$



$T^3 =$  H, F, Cl, Br, I,  $CH_3$ ,  $CH_2CH_3$ , OH,  $OCH_3$ ,  $CF_3$ ,  $OCH_2CH_3$ ,  
 CN,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $N(CH_3)_2$ ,  $COOCH_3$ ,  $COOCH_2CH_3$

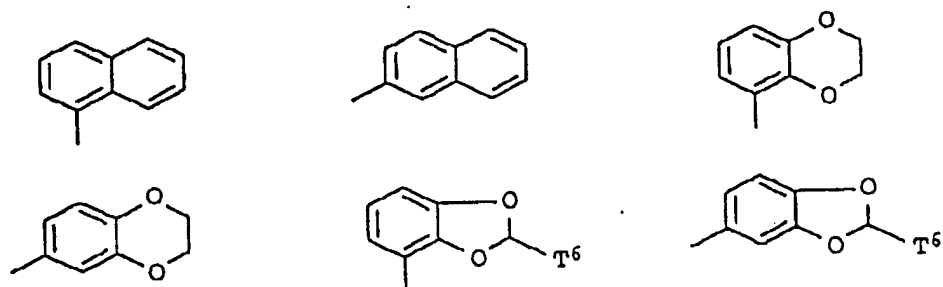


$T^1$ 、 $T^2$ 、 $T^3$ は、上記のように互いに独立にしている（但し、前記の基の1つだけは $NO_2$ であってもよい）



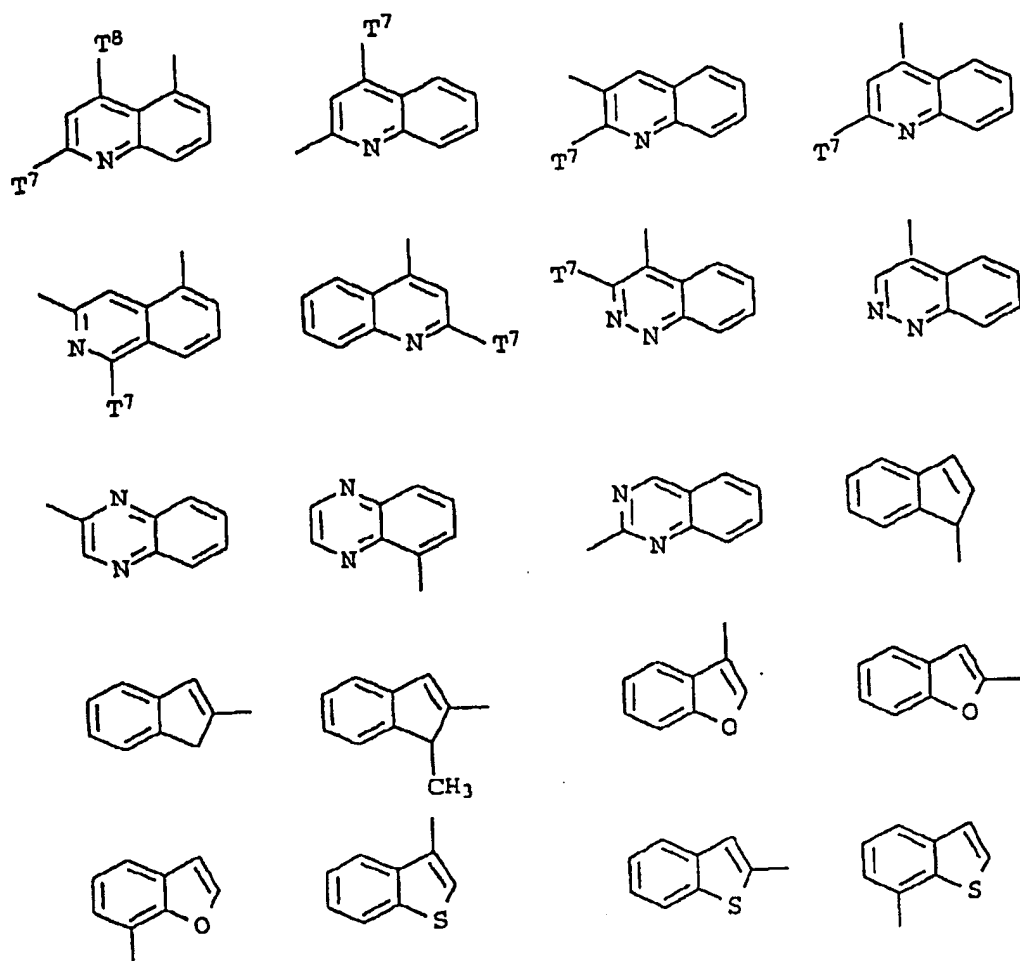
T<sup>4</sup> = H, F, Cl, Br, I, CF<sub>3</sub>, CH<sub>3</sub>, OH, OCH<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>,  
CN, NH<sub>2</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

T<sup>5</sup> = H, F, Cl, Br, I, CF<sub>3</sub>, CH<sub>3</sub>, OH, OCH<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>,  
CN, NH<sub>2</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

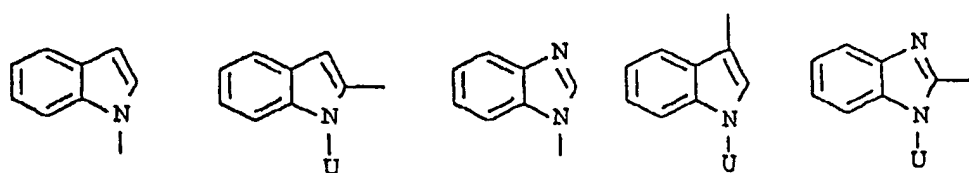


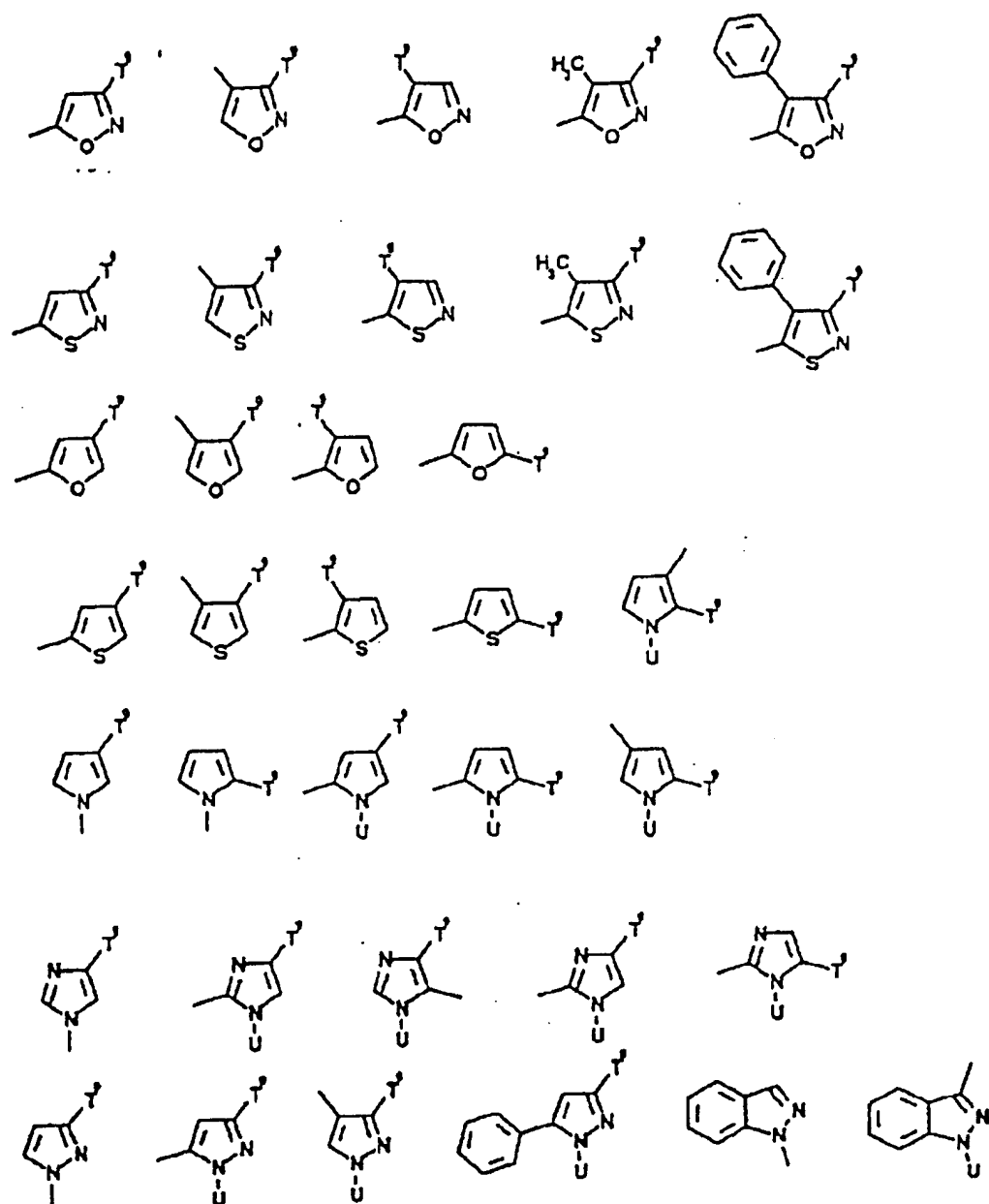
T<sup>6</sup> = H、メチル基、エチル基、n-プロピル基、n-ブチル基、イソプロピル基、第三ブチル基、CF<sub>3</sub>



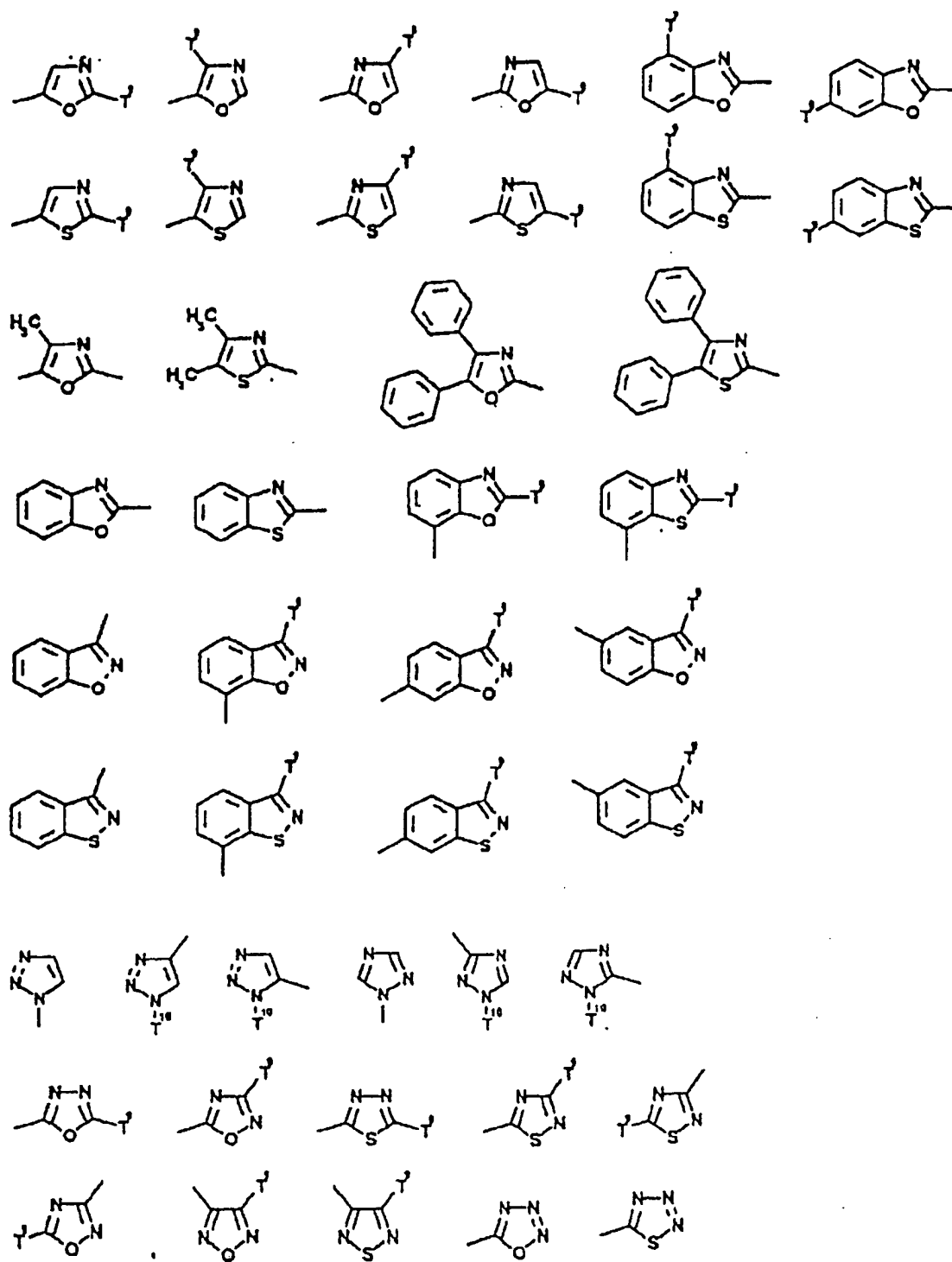


T' = H、メチル基、エチル基、n-プロピル基、n-ブチル基、イソプロピル基、第三ブチル基、CF<sub>3</sub>、



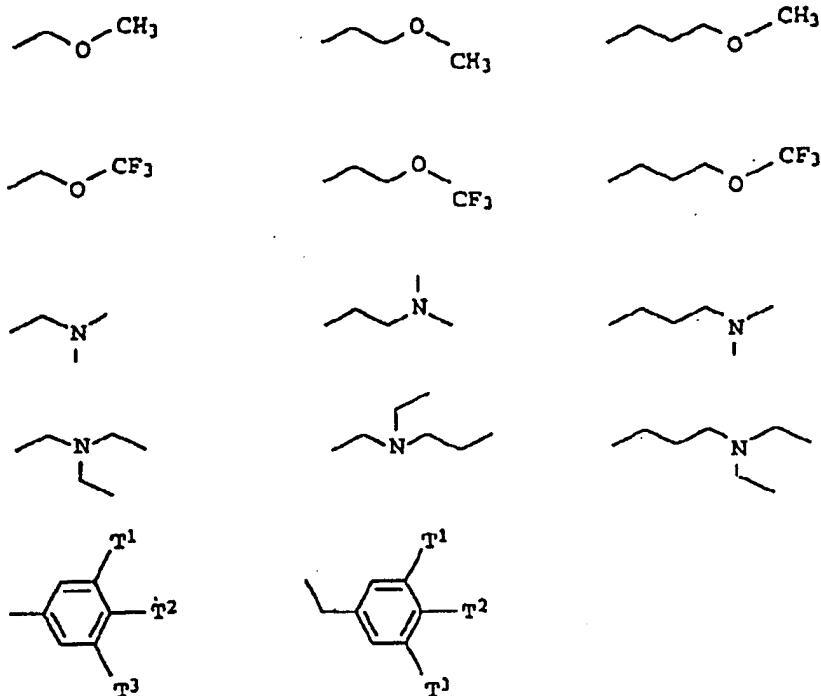


U = H、CH<sub>3</sub>、C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>、ホルミル基、アセチル基、フェニル基、ベンジル基



全ての上記の基の  $T^1 = H, F, Cl, Br, J$ 、メチル基、エチル基、 $n$ -プロピル基、 $n$ -ブチル基、イソプロピル基、第三ブチル基、 $CF_3$ 、 $OCH_3$ 、 $NO_2$ 、 $COOCH_3$ 、 $COOCH_2CH_3$ 、

$T^{10} =$  メチル基、エチル基、プロピル基、ブチル基、ベンジル基

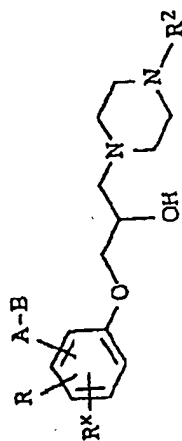


T<sup>1</sup>、T<sup>2</sup>、T<sup>3</sup>は、上記のように互いに独立にしている（但し、前記の基の1つだけはNO<sub>2</sub>であってもよい）

式1の詳細な例は、アミノヘテロ環の型によりZに分類される以下の構造を含む：

（ローマ数字、例えばIIIを用いる記載された化合物および例の表示は、反応式I II～VIII中に示される化合物の分類を参照する）

Z = Z-1 を有するタイプIIIの詳細な例は次のものを包含する:



例 No.	R <sup>2</sup>	A	B	R	R <sup>*</sup>
III-1	ジベンゾスベリレン-5-イル	2-E- $\nu$ = $\nu$	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-2	ビス(4-メトキシ7x=6)-メチル	2-E- $\nu$ = $\nu$	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-3	7x=6-メチル	4-E- $\nu$ = $\nu$	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-4	ジベンゾスベリレン-5-イル	4-E- $\nu$ = $\nu$	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-5	ジベンゾスベリレン-5-イル	2-E- $\nu$ = $\nu$	3-メチル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-6	7x=6-メチル	2-E- $\nu$ = $\nu$	3-メチル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-7	ジベンゾスベリレン-5-イル	2-E- $\nu$ = $\nu$	3-エトキシ-カルボキシ-イソキソノル-5-イル	H	H
III-8	7x=6-メチル	2-E- $\nu$ = $\nu$	3-エトキシ-カルボキシ-イソキソノル-5-イル	H	H
III-9	ジベンゾスベリレン-5-イル	3-E- $\nu$ = $\nu$	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-10	7x=6-メチル	3-E- $\nu$ = $\nu$	3-エトキシ-カルボキシ-イソキソノル-5-イル	H	H
III-11	ジベンゾスベリレン-5-イル	2-E- $\nu$ = $\nu$	3-イソプロピル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-12	7x=6-メチル	2-E- $\nu$ = $\nu$	3-7x=6-イソキソノル-5-イル	H	H
III-13	ジベンゾスベリレン-5-イル	2-E- $\nu$ = $\nu$	3-7x=6-イソキソノル-5-イル	H	H

例 No.	R <sup>2</sup>	A	B	R	R <sup>*</sup>
111-14	ビス(4-フルオロフェニル)-メチル	2-E- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-15	シクロヘキシル-フェニル-メチル	2-Z- $\nu$ -レソ	3-イソプロピル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-16	ジフェニル-メチル	2-Z- $\nu$ -レソ	3-イソプロピル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-17	ジペンタメチル-5-イル	2-E- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	4, 5-(2, 5-ジメチル- ヘキソ-2, 5-ジイル	
111-18	ジペンタメチル-5-イル	2-Z- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-19	ジフェニル-メチル	2-Z- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-20	ジペンタメチル-5-イル	2-E- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-21	シクロヘキシル-フェニル-メチル	3-E- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-22	シクロヘキシル-フェニル-メチル	2-E- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-23	シクロヘキシル-フェニル-メチル	2-E- $\nu$ -レソ	3-フェニル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-24	ジフェニル-メチル	2-E- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-25	ジフェニル-メチル	2-E- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	4, 5-ジメトキシ	
111-26	ジフェニル-メチル	2-E- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	5-ジエチルミノ	H
111-27	ジペンタメチル-5-イル	2-E- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	4, 5-ジメトキシ	
111-28	ジペンタメチル-5-イル	2-E- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	5-ジエチルミノ	H
111-29	シクロヘキシル-フェニル-メチル	2-E- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	4, 5-ジメトキシ	
111-30	シクロヘキシル-フェニル-メチル	2-E- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	5-ジエチルミノ	H
111-31	ジフェニル-メチル	2-E- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	4, 5-ジメトキシ	
111-32	ジフェニル-メチル	2-E- $\nu$ -レソ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H

例 No.	R <sup>2</sup>	A	B	R	R <sup>*</sup>
111-33	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イ	4,5-ジメチル-1,3-ジエン-1,4-ジイ	H
111-34	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イ	4-プロ	H
111-35	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イ	H	H
111-36	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イ	H	H
111-37	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	2-(4-メトキシメチル)-イソキサゾール-4-イ	H	H
111-38	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	2-(4-メトキシメチル)-イソキサゾール-4-イ	H	H
111-39	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	5-(4-メトキシメチル)-1,3,4-ジメチル-2-イ	H	H
111-40	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	5-(4-メトキシメチル)-1,3,4-ジメチル-2-イ	H	H
111-41	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	N-メチル-ピラゾール-4-イ	H	H
111-42	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	3,5-ジメチル-イソキサゾール-4-イ	H	H
111-43	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	3,5-ジメチル-イソキサゾール-4-イ	H	H
111-44	ビス-(4-メトキシメチル)-メチル	2-B-ロニソ	3,5-ジメチル-イソキサゾール-4-イ	H	H
111-45	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	2-メトキシメチル-イソキサゾール-4-イ	H	H
111-46	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	2-メトキシメチル-イソキサゾール-4-イ	H	H
111-47	ビス-(4-メトキシメチル)-メチル	2-B-ロニソ	2-メトキシメチル-イソキサゾール-4-イ	H	H
111-48	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	3,4-ジメチル-2-イ	H	H
111-49	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	3,4-ジメチル-2-イ	H	H
111-50	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	5-メチル-1,3,4-ジメチル-2-イ	H	H
111-51	2-(3,4-ジメトキシメチル)-エチル	2-B-ロニソ	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イ	H	H
111-52	ジペンノスベラソ-5-イ	2-B-ロニソ	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イ	4-ニトロ	H

例 No.	R <sup>2</sup>	A	B	R	R <sup>*</sup>
111-53	ジ7エニル-メチル	2-E-ニル	3-メトキシメチル-イソキチル-5-イル	4-ニトロ	H
111-54	ジ7エニル-メチル	2-E-ニル	5-メトキシメチル-イソキチル-3-イル	H	H
111-55	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-E-ニル	5-メトキシメチル-イソキチル-3-イル	H	H
111-56	ビス(4-メトキシ7エニル)-メチル	2-E-ニル	2-メトキシメチル-7ニル-4-イル	H	H
111-57	シクロヘキシル-7エニル-メチル	2-E-ニル	ビジ-3-イル	H	H
111-58	シクロヘキシル-7エニル-メチル	2-E-ニル	ビジ-2-イル	H	H
111-59	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	3-メトキシメチル-イソキチル-5-イル	H	H
111-60	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	3-メチル-イソキチル-5-イル	H	H
111-61	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	3-イソプロピル-イソキチル-5-イル	H	H
111-62	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	3-7エニル-イソキチル-5-イル	H	H
111-63	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	3-エトキシカルボキシル-イソキチル-5-イル	H	H
111-64	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	チオ7エニル-2-イル	H	H
111-65	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	チオ7エニル-3-イル	H	H
111-66	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	ビジ-2-イル	H	H
111-67	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	ビジ-3-イル	H	H
111-68	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	ビジ-4-イル	H	H
111-69	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	ビリ-2-イル	H	H
111-70	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	ビリ-3-イル	H	H
111-71	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	N-メチル-ビリ-3-イル	H	H
111-72	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	7ニル-2-イル	H	H
111-73	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	7ニル-3-イル	H	H
111-74	ジ6ニル/スベリ-5-イル	2-Z-ニル	3-メチル-イソキチル-5-イル	H	H

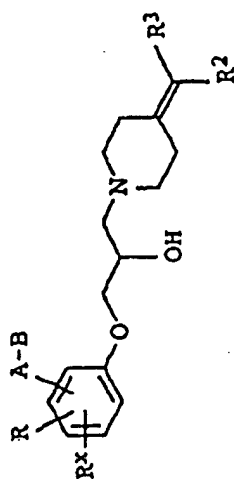


例 No.	R <sup>2</sup>	A	B	R	R <sup>*</sup>
111-75	ジズ/ズズ/5-イ	2-Z-2=V	3-イ/ゾロロ/イ/キ/ゾ-ル-5-イ	H	H
111-76	ジズ/ズズ/5-イ	2-Z-2=V	3-7=ル-イ/キ/ゾ-ル-5-イ	H	H
111-77	ジズ/ズズ/5-イ	2-Z-2=V	3-エ/キ/カ/ル/キ/ゾ-イ/キ/ゾ-ル-5-イ	H	H
111-78	ジズ/ズズ/5-イ	2-Z-2=V	チ/7=ゾ-2-イ	H	H
111-79	ジズ/ズズ/5-イ	2-Z-2=V	チ/7=ゾ-3-イ	H	H
111-80	ジズ/ズズ/5-イ	2-Z-2=V	ロ/ゾ-2-イ	H	H
111-81	ジズ/ズズ/5-イ	2-Z-2=V	ロ/ゾ-3-イ	H	H
111-82	ジズ/ズズ/5-イ	2-Z-2=V	ロ/ゾ-4-イ	H	H
111-83	ジズ/ズズ/5-イ	2-Z-2=V	ロ/ゾ-ル-2-イ	H	H
111-84	ジズ/ズズ/5-イ	2-Z-2=V	ロ/ゾ-ル-3-イ	H	H
111-85	ジズ/ズズ/5-イ	2-Z-2=V	N-チ/ル-ロ/ゾ-ル-2-イ	H	H
111-86	ジズ/ズズ/5-イ	2-Z-2=V	N-チ/ル-ロ/ゾ-ル-3-イ	H	H
111-87	ジズ/ズズ/5-イ	2-Z-2=V	7/ゾ-2-イ	H	H
111-88	ジズ/ズズ/5-イ	2-Z-2=V	7/ゾ-3-イ	H	H
111-89	ジ7=ル-チ	2-Z-2=V	3-チ/キ/チ/ル-イ/キ/ゾ-ル-5-イ	H	H
111-90	ジ7=ル-チ	2-Z-2=V	3-チ/ル-イ/キ/ゾ-ル-5-イ	H	H
111-91	ジ7=ル-チ	2-Z-2=V	3-イ/ゾロロ/イ/キ/ゾ-ル-5-イ	H	H
111-92	ジ7=ル-チ	2-Z-2=V	3-7=ル-イ/キ/ゾ-ル-5-イ	H	H
111-93	ジ7=ル-チ	2-Z-2=V	3-エ/キ/カ/ル/キ/ゾ-イ/キ/ゾ-ル-5-イ	H	H
111-94	ジ7=ル-チ	2-Z-2=V	チ/7=ゾ-2-イ	H	H
111-95	ジ7=ル-チ	2-Z-2=V	チ/7=ゾ-3-イ	H	H
111-96	ジ7=ル-チ	2-Z-2=V	ロ/ゾ-2-イ	H	H

例 No.	R <sup>2</sup>	A	B	R	R <sup>*</sup>
111-97	ジ7エ=ル-ジチル	2-2-ロ=ロ	ロリジソ-3-イ	H	H
111-98	ジ7エ=ル-ジチル	2-2-ロ=ロ	ロリジソ-4-イ	H	H
111-99	ジ7エ=ル-ジチル	2-2-ロ=ロ	ロリジソ-2-イ	H	H
111-100	ジ7エ=ル-ジチル	2-2-ロ=ロ	ロリジソ-3-イ	H	H
111-101	ジ7エ=ル-ジチル	2-2-ロ=ロ	N-ジチル-ロリジソ-2-イ	H	H
111-102	ジ7エ=ル-ジチル	2-2-ロ=ロ	N-ジチル-ロリジソ-3-イ	H	H
111-103	ジ7エ=ル-ジチル	2-2-ロ=ロ	77ソ-2-イ	H	H
111-104	ジ7エ=ル-ジチル	2-2-ロ=ロ	77ソ-3-イ	H	H
111-105	ジ7エ=ル-ジチル	2-2-ロ=ロ	ロロ-2-イ	H	H
111-106	ジ7エ=ル-7エ=ル-ジチル	2-E-ロ=ロ	ロリジソ-4-イ	H	H
111-107	ジ7エ=ル-7エ=ル-ジチル	2-E-ロ=ロ	N-ジチル-ロロ-2-イ	H	H
111-108	ジ7エ=ル-ジチル	2-E-ロ=ロ	N-ジチル-ロロ-2-イ	H	H
111-109	ジ7エ=ル-ジチル	2-E-ロ=ロ	ロリジソ-4-イ	H	H
111-110	ジ7エ=ル-ジチル	2-E-ロ=ロ	ロリジソ-3-イ	H	H
111-111	ジ7エ=ル-ジチル	2-E-ロ=ロ	ロリジソ-2-イ	H	H
111-112	(9H)-キチンソ-9-イ-ル-カルボキシ	2-E-ロ=ロ	3-メトキシジチル-イソキソ-ル-5-イ	H	H
111-113	ジ7エ=ル-7エ=ル-7エチル	2-E-ロ=ロ	3-メトキシジチル-イソキソ-ル-5-イ	H	H
111-114	ジ7エ=ル-7エ=ル-5-イ	2-E-ロ=ロ	3-メトキシジチル-イソキソ-ル-5-イ	5-7ル	H
111-115	ジ7エ=ル-ジチル	2-E-ロ=ロ	3-メトキシジチル-イソキソ-ル-5-イ	5-7ル	H
111-116	ジ7エ=ル-7エ=ル-5-イ	2-E-ロ=ロ	4-ジチル-1, 3-ジチル-3-イ	H	H
111-117	ジ7エ=ル-ジチル	2-E-ロ=ロ	4-ジチル-1, 3-ジチル-3-イ	H	H
111-142	ジ7エ=ル-7エ=ル-5-イ	2-E-ロ=ロ	3-トリフルオロメチル-イソキソ-ル-5-イ	H	H

例 No.	R <sup>2</sup>	A	B	R	R <sup>1</sup>
111-143	ジフェル-メチル	2-E-ピニル	3-トリフルオロメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-144	ジペンジスベリノ-5-イル	2-E-ピニル	3-トリフルオロメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-145	ビス(-4-フルオロフェニル)メチル	2-E-ピニル	3-イソプロピル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-146	ジフェル-7セチル	2-E-ピニル	3-イソプロピル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-147	ジペンジスベリノ-5-イル	2-E-ピニル	3-メトキシ-イソキソノル-5-イル	H	H
111-148	ジペンジスベリノ-5-イル	2-Z-ピニル	3-メトキシ-イソキソノル-5-イル	H	H
111-149	ジフェル-7セチル	2-E-ピニル	3-メトキシ-イソキソノル-5-イル	H	H
111-150	ジフェル-7セチル	2-Z-ピニル	3-メトキシ-イソキソノル-5-イル	H	H
111-155	ジフェル-7セチル	2-E-ピニル	3-トリフルオロメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-156	ビス(4-フルオロフェニル)メチル	2-E-ピニル	3-トリフルオロメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
111-157	ジフェル-7セチル	2-E-ピニル	2-メトキシメチル-7-イソノル-4-イル	H	H
111-158	ジペンジスベリノ-5-イル	2-E-ピニル	2-メトキシメチル-1,3,4-チリジノル-5-イル	H	H
111-159	ジフェル-7セチル	2-E-ピニル	2-メトキシメチル-1,3,4-チリジノル-5-イル	H	H
111-160	ジフェル-7セチル	2-E-ピニル	2-メトキシメチル-1,3,4-チリジノル-5-イル	H	H
111-161	ジペンジスベリノ-5-イル	2-Z-ピニル	2-メトキシメチル-1,3,4-チリジノル-5-イル	H	H
111-162	ビス(4-フルオロフェニル)メチル	2-E-ピニル	2-メトキシメチル-1,3,4-チリジノル-5-イル	H	H
111-163	シクロヘキシル-7-フェニル	2-E-ピニル	2-メトキシメチル-1,3,4-チリジノル-5-イル	H	H

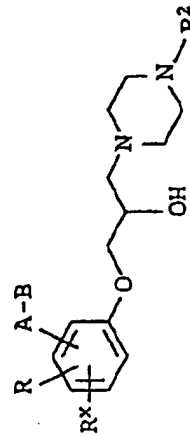
Z = Z - 2 を有するタイプIIIの詳細な例は次のものを包含する:



例 No.	R <sup>2</sup> =R <sup>3</sup>	A	B	R	R <sup>*</sup>
III-118	フェニル	2-E- $\beta$ - $\beta$	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-119	フェニル	4-E- $\beta$ - $\beta$	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-120	フェニル	2-B- $\beta$ - $\beta$	3-メチル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-121	フェニル	2-B- $\beta$ - $\beta$	3-エトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-122	フェニル	3-B- $\beta$ - $\beta$	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-123	フェニル	2-B- $\beta$ - $\beta$	3-イソプロピル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-124	フェニル	2-E- $\beta$ - $\beta$	3-7- $\beta$ - $\beta$ -イソキソノル-5-イル	H	H
III-125	フェニル	2-Z- $\beta$ - $\beta$	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-126	フェニル	2-Z- $\beta$ - $\beta$	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-127	フェニル	2-B- $\beta$ - $\beta$	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	5-ジエチルアミノ	H
III-128	フェニル	2-B- $\beta$ - $\beta$	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	4,5-ジメトキシ	H
III-129	フェニル	2-B- $\beta$ - $\beta$	3,5-ジメチル-イソキソノル-4-イル	H	H
III-130	フェニル	2-B- $\beta$ - $\beta$	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	4-ニトロ	H

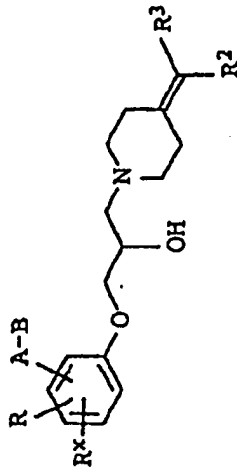
例	R <sup>2</sup> =R <sup>3</sup>	A	B	R	R <sup>*</sup>
III-131	フェニル	2-B-ピリッ	3-トキシメチル-イソキソル-5-イル	6-7メチ	H
III-132	フェニル	2-B-ピリッ	4-ジメチル-1,3-オキサソリン-2-イル	H	H
III-151	フェニル	2-B-ピリッ	5-トキシメチル-イソキソル-3-イル	H	H
III-152	フェニル	2-B-ピリッ	3,5-ジメチル-イソキソル-4-イル	H	H
III-162	フェニル	2-B-ピリッ	トリメチルメチル-イソキソル-5-イル	H	H
III-163	フェニル	2-B-ピリッ	2-トキシメチル-イソキソル-4-イル	H	H
III-164	フェニル	2-B-ピリッ	2-トキシメチル-1,3,4-トリメチル-5-イル	H	H

Z = Z - 1 を有するタイプIIIの詳細な例は次のものを包含する：



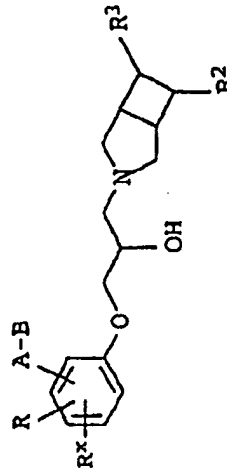
例	R <sup>2</sup>	A	B	R=R <sup>*</sup>
III-133	シベツスベツ-5-イル	2-B-(メチル)-ピリッ	3-トキシメチル-イソキソル-5-イル	H
III-134	シベツスベツ-5-イル	2-Z-(メチル)-ピリッ	3-トキシメチル-イソキソル-5-イル	H
III-135	シクエニル-メチル	2-B-(メチル)-ピリッ	3-トキシメチル-イソキソル-5-イル	H
III-136	シクエニル-メチル	2-Z-(メチル)-ピリッ	3-トキシメチル-イソキソル-5-イル	H

Z = Z-2 を有するタイプIIIの詳細な例は次のものを包含する:



例	$R^2 = R^3$	A	B	$R = R^*$
III-137	7x=n	2-E-(メチル)-ピニル	3-メトキシメチル-イソキソノール-5-イル	H
III-138	7x=n	2-Z-(メチル)-ピニル	3-メトキシメチル-イソキソノール-5-イル	H

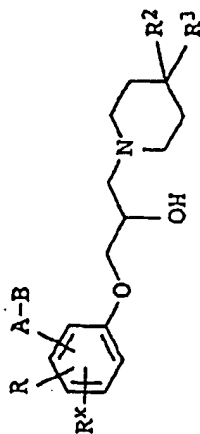
Z = Z-3 を有するタイプIIIの詳細な例は次のものを包含する:



例	$R^2$	$R^3$	A	B	R	$R^*$
III-139	6-7x=n	7-7x=n	2-E-ピニル	3-メトキシメチル-イソキソノール-5-イル	H	H
III-140	(4-7nオロ-7x=n)	H	2-B-ピニル	3-メトキシメチル-イソキソノール-5-イル	H	H

例	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	B	R	R <sup>*</sup>
III-141	4-第三ブチル-フェニル	H	2-E-ピニル	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	3,4-ブタジエン-1,4-ジイル	H
III-153	6-フェニル	7-フェニル	2-E-ピニル	3-イソプロピル-イソキソノル-5-イル	H	H
III-154	4-第三ブチル-フェニル	H	2-E-ピニル	5-メトキシメチル-イソキソノル-3-イル	H	H

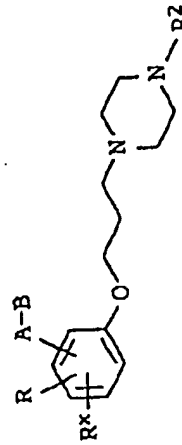
Z = Z - 4 を有するタイプ III の詳細な例は次のものを包含する：



例	R <sup>2</sup> = R <sup>3</sup>	A	B	R = R <sup>*</sup>
III-165	フェニル	2-E-ピニル	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H
III-166	フェニル	2-Z-ピニル	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H
III-167	フェニル	3-E-ピニル	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H
III-168	フェニル	3-Z-ピニル	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H
III-169	フェニル	4-E-ピニル	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H
III-170	フェニル	4-Z-ピニル	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H

例	R <sup>2</sup> +R <sup>3</sup>	A	B	R=R <sup>*</sup>
III-171	ジベンジスベリオン-5-イリデン	2-E-ピニル	3-メチキシメチル-イリキシノール-5-イル	H
III-172	ジベンジスベリオン-5-イリデン	2-Z-ピニル	3-メチキシメチル-イリキシノール-5-イル	H
III-173	ジベンジスベリオン-5-イリデン	3-E-ピニル	3-メチキシメチル-イリキシノール-5-イル	H
III-174	ジベンジスベリオン-5-イリデン	3-Z-ピニル	3-メチキシメチル-イリキシノール-5-イル	H
III-175	ジベンジスベリオン-5-イリデン	4-E-ピニル	3-メチキシメチル-イリキシノール-5-イル	H
III-176	ジベンジスベリオン-5-イリデン	4-Z-ピニル	3-メチキシメチル-イリキシノール-5-イル	H
III-177	ジベンジスベリオン-5-イリデン	2-E-ピニル	3-メチキシメチル-イリキシノール-5-イル	H
III-178	ジベンジスベリオン-5-イリデン	2-Z-ピニル	3-メチキシメチル-イリキシノール-5-イル	H
III-179	ジベンジスベリオン-5-イリデン	2-E-ピニル	2-メチキシメチル-イリキシノール-4-イル	H

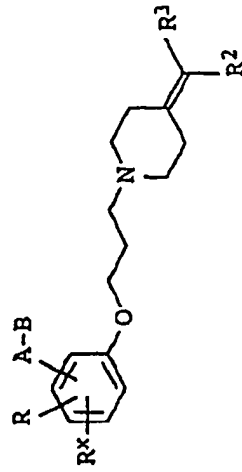
Z = Z-1 を有するタイプIVの詳細な例は次のものを包含する:



例	R <sup>2</sup>	A	B	R=R <sup>*</sup>
IV-1	ジフェニル-メチル	2-E-ピニル	3-メチキシメチル-イリキシノール-5-イル	H
IV-2	ジベンジスベリオン-5-イル	2-E-ピニル	3-メチキシメチル-イリキシノール-5-イル	H
IV-3	ジフェニル-7-セチル	2-E-ピニル	3-メチキシメチル-イリキシノール-5-イル	H
IV-4	シクロヘキシル-7-エチル-メチル	2-E-ピニル	3-メチキシメチル-イリキシノール-5-イル	H

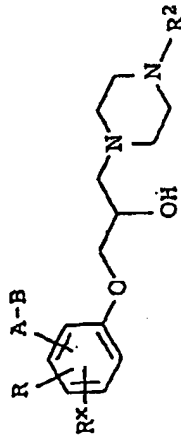


Z = Z-2 を有するタイプ IV の詳細な例は次のものを包含する：



例	R <sup>2</sup>	A	B	R = R <sup>*</sup>
IV-5	フェニル	2-B-ℓ=ℓ	3-メチルシメチル-イソキソノル-5-イル	H
IV-6	フェニル	2-Z-ℓ=ℓ	3-メチルシメチル-イソキソノル-5-イル	H
IV-7	フェニル	3-B-ℓ=ℓ	3-メチルシメチル-イソキソノル-5-イル	H
IV-8	フェニル	3-Z-ℓ=ℓ	3-メチルシメチル-イソキソノル-5-イル	H
IV-9	フェニル	4-B-ℓ=ℓ	3-メチルシメチル-イソキソノル-5-イル	H
IV-10	フェニル	4-Z-ℓ=ℓ	3-メチルシメチル-イソキソノル-5-イル	H

Z = Z-1 を有するタイプ V の詳細な例は次のものを包含する:

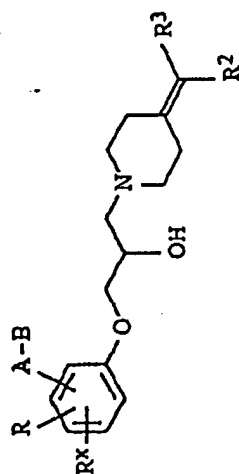


例	R <sup>2</sup>	A	B	R=R <sup>*</sup>
V-1	ジベンジスベリル-5-イル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジベンジスベリル-5-イル	H
V-2	ジベンジスベリル-5-イル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジベンジスベリル-5-イル	H
V-3	ジフェニル-メチル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジフェニル-メチル-5-イル	H
V-4	ジフェニル-メチル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジフェニル-メチル-5-イル	H
V-5	ジクロロベンジル-7-エニル-メチル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジクロロベンジル-7-エニル-メチル-5-イル	H
V-6	ジフェニル-メチル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジフェニル-メチル-5-イル	H
V-7	ジベンジスベリル-5-イル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジベンジスベリル-5-イル	H
V-8	ジベンジスベリル-5-イル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジベンジスベリル-5-イル	H
V-9	ジベンジスベリル-5-イル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジベンジスベリル-5-イル	H
V-10	ジベンジスベリル-5-イル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジベンジスベリル-5-イル	H
V-11	ジベンジスベリル-5-イル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジベンジスベリル-5-イル	H
V-12	ジベンジスベリル-5-イル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジベンジスベリル-5-イル	H
V-13	ジベンジスベリル-5-イル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジベンジスベリル-5-イル	H
V-14	ジベンジスベリル-5-イル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジベンジスベリル-5-イル	H
V-15	ジベンジスベリル-5-イル	2-メチレンオキソ	3-メチレンオキソ-1,4-ジベンジスベリル-5-イル	H

例	R <sup>1</sup>	A	B	R=R <sup>*</sup>
V-16	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	ビリ/ル-2-1ル	H
V-17	ジケン/スベリ/5-1ル	メチルオキシ	ビリ/ル-3-1ル	H
V-18	ジケン/スベリ/5-1ル	メチルオキシ	N-メチル-ビリ/ル-2-1ル	H
V-19	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	フリン-2-1ル	H
V-20	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	フリン-3-1ル	H
V-21	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	3-メトキシメチル-イソキソ/ル-5-1ル	H
V-22	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	3-メチル-イソキソ/ル-5-1ル	H
V-23	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	3-イソプロピル-イソキソ/ル-5-1ル	H
V-24	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	3-フェニル-イソキソ/ル-5-1ル	H
V-25	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	3-エトキシカルボキシ-イソキソ/ル-5-1ル	H
V-26	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	チオフェン-2-1ル	H
V-27	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	チオフェン-3-1ル	H
V-28	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	ビリジン-2-1ル	H
V-29	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	ビリジン-3-1ル	H
V-30	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	ビリジン-4-1ル	H
V-31	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	ビリ/ル-2-1ル	H
V-32	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	ビリ/ル-3-1ル	H
V-33	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	N-メチル-ビリ/ル-2-1ル	H
V-34	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	N-メチル-ビリ/ル-3-1ル	H
V-35	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	フリン-2-1ル	H
V-36	ジケン/スベリ/5-1ル	2-メチルオキシ	フリン-3-1ル	H
V-37	ジフェニル-メチル	2-メチルオキシ	3-フェニル-イソキソ/ル-5-1ル	H

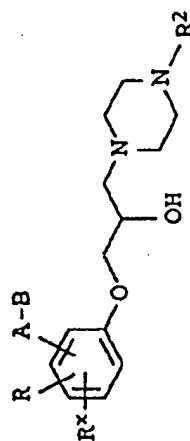
例	R <sup>2</sup>	A	B	R = R <sup>*</sup>
V-38	ジフエニル-メチル	2-メチルンオキシ	3-エトキシカルボキシ-イソキサゾール-5-イル	H
V-39	ジフエニル-メチル	2-メチルンオキシ	チオフェン-2-イル	H
V-40	ジフエニル-メチル	2-メチルンオキシ	チオフェン-3-イル	H
V-41	ジフエニル-メチル	2-メチルンオキシ	ピリジン-2-イル	H
V-42	ジフエニル-メチル	2-メチルンオキシ	ピリジン-3-イル	H
V-43	ジフエニル-メチル	2-メチルンオキシ	ピリジン-4-イル	H
V-44	ジフエニル-メチル	2-メチルンオキシ	ピラゾール-2-イル	H
V-45	ジフエニル-メチル	2-メチルンオキシ	ピラゾール-3-イル	H
V-46	ジフエニル-メチル	2-メチルンオキシ	N-メチル-ピラゾール-2-イル	H
V-47	ジフエニル-メチル	2-メチルンオキシ	N-メチル-ピラゾール-3-イル	H
V-48	ジフエニル-メチル	2-メチルンオキシ	7-ラノ-2-イル	H
V-49	ジフエニル-メチル	2-メチルンオキシ	7-ラノ-3-イル	H
V-50	フエニル	2-メチルンオキシ	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
V-51	フエニル	2-メチルンオキシメチレン	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
V-52	ジフエニル-メチル	2-メチルンオキシ	3-イソプロピル-イソキサゾール-5-イル	H

Z = Z - 2 を有するタイプ V の詳細な例は次のものを包含する:



例	R <sup>2</sup> = R <sup>3</sup>	A	B	R = R <sup>*</sup>
V-53	フェニル	2-メチレンオキシ	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H
V-54	フェニル	2-メチレンオキシメチレン	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H

Z = Z - 1 を有するタイプ VI の詳細な例は次のものを包含する:



例	R <sup>2</sup>	A	B	R = R <sup>*</sup>
VI-1	ジフェニル-メチル	2-エチレン	4,5-ジメチル-オキソノル-2-イル	H
VI-2	ジペンメスベレン-5-イル	2-エチレン	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H
VI-3	ジフェニル-メチル	2-エチレン	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H
VI-4	ジフェニル-7セチル	2-エチレン	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H
VI-5	ジクロロキシル-7エニル-メチル	2-エチレン	3-メトキシメチル-イソキソノル-5-イル	H